

⑨ 日本国特許庁 (JP) ⑩ 特許出願公開  
 ⑪ 公開特許公報 (A) 昭57-203066

⑫ Int. Cl.<sup>3</sup>  
 C 07 D 215/22  
 A 01 N 43/42  
 43/60

識別記号  
 101  
 101

府内整理番号  
 6675-4C  
 7055-4H  
 7055-4H

⑬ 公開 昭和57年(1982)12月13日  
 発明の数 3  
 審査請求 未請求  
 (全 6 頁)

⑭ フェノキシプロピオン酸グリシジルエステル  
 誘導体およびその製法並びに除草剤

⑮ 発明者 学工業株式会社中央研究所内  
 猪飼隆  
 埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡  
 1470日産化学工業株式会社生物  
 化学研究所内  
 小口寿彦  
 埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡  
 1470日産化学工業株式会社生物  
 化学研究所内  
 田中一郎  
 日産化学工業株式会社  
 東京都千代田区神田錦町3丁目  
 7番地1

⑯ 特 願 昭56-86987

⑰ 出 願 昭56(1981)6月8日

⑱ 発明者 坂田五常  
 船橋市坪井町722番地1日産化  
 学工業株式会社中央研究所内

⑲ 発明者 沼田達雄  
 船橋市坪井町722番地1日産化  
 学工業株式会社中央研究所内

⑳ 発明者 草野和也  
 船橋市坪井町722番地1日産化

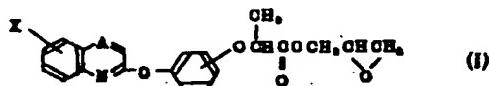
### 明細書

#### 1.発明の名称

フェノキシプロピオン酸グリシジルエステル  
 誘導体およびその製法並びに除草剤

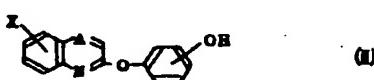
#### 2.特許請求の範囲

##### (1) 一般式(I) :



(式中、△はOHまたは塩素原子を表わし。  
 Xは水素原子、ヘロダニン原子、またはトリ  
 フルオロメチル基を表わす。)  
 で表わされるフェノキシプロピオン酸グリシ  
 ジルエステル誘導体。

##### (2) 一般式(II) :



(式中、△はOHまたは塩素原子を表わし。  
 Xは水素原子、ヘロダニン原子、またはトリ

フルオロメチル基を表わす。)で表わされる  
 フェノキシフェノール誘導体または、その塩  
 と

##### 一般式(III) :



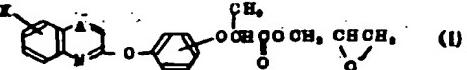
(式中、△はヘロダニン原子を表わす。)で表  
 わされるα-ヘロダニノプロピオン酸グリシジ  
 ルエステルとを不活性溶媒中で、吸受容体の  
 存在下で反応させることを特徴とする

##### 一般式(IV) :



(式中、△およびXは、前記と同じ意味を表  
 わす。)で表わされるフェノキシプロピオン  
 酸グリシジルエステル誘導体の製法。

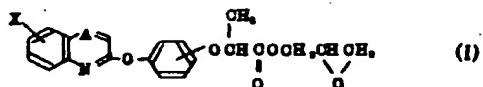
##### (5) 一般式(V) :



(式中、△はOHまたは塩素原子を表わし、エは水素原子、ヘロゲン原子、またはトリフルオロメチル基を表わす。)で表わされるフェノキシプロピオニ酸タリシジルエステル誘導体の1種または2種以上を有効成分として含有することを特徴とする選択性除草剤。

### 3. 発明の詳細を説明

本身明以一致式(I)：



(式中、△はOH または塩素原子を表わし、Xは水素原子、ハロゲン原子、またはトリフルオロメチル基を表わす。)

て挿入されるフェノキシプロピオニ酸タリシジルエステル誘導体、その誘導体および該誘導体を有効成分とする選択性除草剤に関するものである。

上記一般式(I)で表わされるフェノキシプロピオニ酸ダリシジルエステル誘導体（以下單に本発

特開昭57-203066(2)

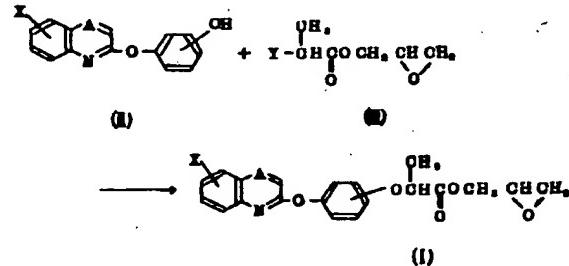
明化合物という。)は、文献未載の新規化合物であり、除草剤の有効成分として有用な化合物である。

従来、ある種のウ - [4 - (2 - ピリジルオキシ)フェノキシ] 脂防酸グリシルエステル誘導体が除草活性を有することが知られている（特開昭54-39031号公報参照）が、これらはフェノキシ基の置換基がアリール基とピリジル基に限定されているものである。

本発明化合物は、一般式(I)に示されるよう>Ifエノキシ基に有する置換基が縮合含窒素ヘテロ環、則ち、キノリル基およびキノキナザリル基である化合物群で、異なる化学構造を有する新規化合物群であり。かつまた土壤処理および選葉処理のいずれにおいても、特に禾本科植物に対し優れた除草効果を有するものであり、一方棉、大豆、ピート、ナタネ、ダイコン、カンランおよびナスなどの蔬菜作物に対しては葉害はほとんどないという特色を有しているものである。本発明化合物の製法としては、下記反応式に従

って容易に製造できる。

皮底式



(上記反応式中、 $\Delta$  は OH または塩素原子を表わし、 $\times$  は水素原子、ヘロダニ原素、またはトリフルオロメチル基を表わし、 $\square$  はヘロダニ原素を表わす。)

上記の反応は、膜受容体の存在下、不活性糖様中ににおいて通常1～12時間加熱還流して行なわれる。不活性糖様としてメチルエチルケトン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等の一般的の不活性糖様が用いられ、膜受容体としては炭酸カリウム等が用いられる。反応式中、 $\ddot{\sigma}$ で

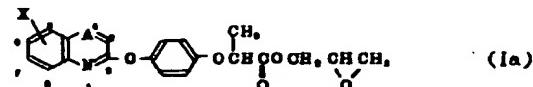
表わされるハロゲン原子としては、通常塩素又は臭素が使用される。

反応液を冷水に注いで過剰な有機酸銀で抽出し  
有機酸銀層を水洗、乾燥後濾紙を留去すれば、  
良好な本品が得られる。

この様にして合成した本発明化合物の具体例について、その物性とともに第1表及び第2表に記載する。但し、本発明化合物は、これらのみに限定されるものではない。

一 著

次式 1a :

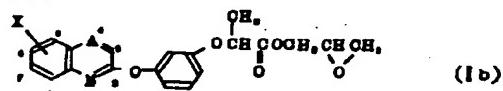


## で表わされる化合物の合成

化合物	X	A	性状・物性
1	6-Cl	N	白色結晶 mp 83~86°C
2	7-Br	N	/ mp 102~104°C
3	6-F	N	/ mp 82~85°C
4	6-OF <sub>2</sub>	N	/ mp 72~75°C
5	H	N	/ mp 87~90°C
6	H	CH	/ mp 56~59°C

第2表

次式 Ib:



## で表わされる化合物の合成

化合物	X	A	性状・物性
7	6-Cl	N	淡黄色液体, mp ~20°C, N <sub>D</sub> <sup>20</sup> 1.5892
8	7-Br	N	/ mp ~15°C, N <sub>D</sub> <sup>20</sup> 1.5932

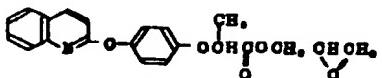
ロマトグラフィーで精製すると本発明化合物6の白色結晶(0.9g)が得られる。

mp 5.6~5.9°C。

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>, δ-値): 1.65(d, 3H), 2.5~2.8(m, 2H), 3.0~3.3(m, 1H), 3.9~4.6(m, 2H), 4.81(q, 1H), 7.08(q, 4H), 7.61(b, 2H), 8.00(b, 1H), 8.62(s, 1H)

## 合成例2

*α*-(4-(キノリル-2-オキシ)フェノキシ)プロピオン酸グリシルエステルの合成



(本発明化合物6)

4-(キノリル-2-オキシ)フェノール(1.7g), *α*-ブロムプロピオン酸グリシルエステル(1.7g), 及び無水炭酸カリウム(1.0g)を加えたアセトニトリル溶液100mlを5時間加熱還流させる。

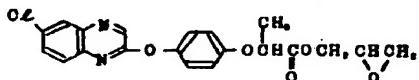
合成例1と同様の後処理方法、精製方法によつ

て第1表及び第2表中の本発明化合物6は、以下の合成例、配合例および試験例について参照される。

次に、本発明化合物について、具体的な合成例を挙げて説明する。

## 合成例1

*α*-(4-(6-クロロキノリル-2-オキシ)フェノキシ)プロピオン酸グリシルエステルの合成



(本発明化合物1)

*α*-(6-クロロキノリル-2-オキシ)フェノール(1.5g), *α*-ブロムプロピオン酸グリシルエステル(1.7g), 及び無水炭酸カリウム(2.0g)を加えたアセトニトリル溶液100mlを5時間加熱還流させる。

反応終了後、不溶物を沪別し、沪液を減圧下濃縮し、得られる油状残渣をシリカゲルカラムク

リジングで洗浄する。洗浄液を減圧下濃縮して本発明化合物6の白色結晶(0.9g)が得られる。mp 5.6~5.9°C。

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>, δ-値): 1.73(d, 3H), 2.5~2.7(m, 1H), 2.80(t, 1H), 3.1~3.3(m, 1H), 3.9~4.6(m, 2H), 4.80(q, 1H), 7.04(q, 4H), 7.1~8.1(m, 6H)

本発明化合物を除草剤として施用するにあたっては、一般には適当な担体、例えばタレー、タルク、ペントナイト、珪藻土等の固体担体あるいは水、アルコール類(メタノール、エタノール等)、芳香族炭化水素類(ベンゼン、トルエン、キシレン等)、塩素化炭化水素類、エーテル類、ケトン類、エステル類(酢酸エチル等)、級アミド類(ジメチルホルムアミド等)などの液体担体と適用することができます。所望により乳化剤、分散剤、懸濁剤、浸透剤、展着剤、安定剤などを添加し、被剤、乳剤、水剤剤、粉剤、粒剤等任意の剤型にて実用に供することができます。

また、必要に応じて緩衝または散布時に他の

除草剤、各種殺虫剤、殺菌剤、植物調剤、共力剤などと混合施用しても良い。

上記の他の種の除草剤としては、例えば、3-(4-メチルフェニエテルオキシフェニル)-1-メチル-1-メトキシクレア及びファーム・ケミカルズ・ヘンドブック (Farm Chemicals Handbook), 第67版(1981), に記載されている化合物などがある。

次に、本発明化合物を有効成分とする除草剤の配合例を示す。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

#### 配合例1 水和剤

本発明化合物A1	5.0部
ジーライト△(商品名)	4.6部
ソルボール5039(界面活性剤、東邦化学製)	2部
カーブレックス(固結防止剤、塗料樹脂用)	2部
以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。使用に際しては上記水和剤を水で50~1000倍に希釈して、有効成分量が10アール当たり5~1000gになるように散布する。	

ことができ、その施用薬量は適用場面、施用時期、施用方法、対象雑草、栽培作物等により差異はあるが、一般には有効成分量として10アール当たり5~1000g程度が適当である。

次に、本発明化合物の除草剤としての有用性を以下の試験例において具体的に説明する。

#### 試験例1 土壌処理による除草効果試験

縦15cm、横2.2cm、深さ6cmのプラスチック製箱に収容した供試土壌を入れ、イネ、ノビエ、メヒシバ、コアカザ、スペリヒニ、ヘキダメガタ、イスガラシを播種し、約1.5cm覆土した後有効成分量が所定の割合となるように土壌表面へ均一に散布した。

散布の際の薬液は、前記配合例の本和剤または乳剤を水で希釈して小瓶スプレーで全面に散布した。薬液散布3週間後に各種雑草に対する除草効果を下記の判定基準に従い調査した。

結果は第3表に示す。

#### 判定基準

5...除草率90%以上(ほとんど完全枯死)

#### 配合例2 乳 剤

本発明化合物A2	2.0部
ヤシレン	7.5部
ソルボール2680(界面活性剤、東邦化学製)	5部

以上を均一に混合して乳剤とする。使用に際しては上記乳剤を水で50~1000倍に希釈して、有効成分量として10アール当たり5~1000gを散布する。

本発明化合物は、土壤散布または莢葉散布のいずれの処理においても各種雑草、特に禾本科雑草に対しては極めてすぐれた除草効力を示す一方広葉の栽培作物、例えば蕎麦、大豆、小豆、菜豆、ピート、ナタネ、ダイコン、カンラン、ナス、等に対する被害は認められない。

従って本発明化合物は農園農分野、特に畠地用除草剤として広葉作物の栽培時における禾本科雑草の選択性的防除には好適である。

なお、本発明化合物は畠地、水田、果樹園などの農園農分野以外に運動場、空地、緑蔭地など非農耕地における各種雑草の防除にも適用する

4...除草率70~90%

3...除草率40~70%

2...除草率20~40%

1...除草率10~20%

0...除草率5%以下(ほとんど効力なし)

但し、上記の除草率は、薬剤処理区の地上部生草重および無処理区の地上部生草重を測定して下記の式により求めたものである。

$$\text{除草率} = \left( \frac{\text{處理区の地上部生草重}}{\text{無處理区の地上部生草重}} \right) \times 100$$

第3表

化合物 名	有効成分の 処理量(%)	種	ノ ビ エ	メ ヒ シ バ	コ ア カ ザ	ス ペ リ ヒ ユ	ハ ヤ ダ メ ギ タ	イ ス ガ ラ シ
1	50	5	5	5	0	0	0	0
	25	5	5	5	0	0	0	0
2	50	5	5	5	0	0	0	0
	25	5	5	5	0	0	0	0
3	50	5	5	5	0	0	0	0
	25	5	5	5	0	0	0	0
4	50	5	5	5	0	0	0	0
	25	5	5	5	0	0	0	0
5	50	5	5	5	0	0	0	0
	25	5	5	5	0	0	0	0
6	50	5	5	5	0	0	0	0
	25	5	5	5	0	0	0	0
7	50	5	5	5	0	0	0	0
	25	5	5	5	0	0	0	0
8	50	5	5	5	0	0	0	0
	25	5	5	5	0	0	0	0

## 試験例2 薬葉処理による除草効果試験

縦15cm、横22cm、深さ6cmのプラスチック製箱に収容した供試土壌を入れ、イネ、ノビエ、メヒシバ、コアカザ、スペリヒユ、ハヤダメギタ、イスガラシの種子をそれぞれスポット状に播種し、約1.5cm覆土した。各種雑草が2~3葉期に達したとき、有効成分量が所定の割合となるように薬葉液へ均一に散布した。

散布の際の薬液は前記配合例の水和剤または乳剤を水で希釈し、小型スプレーで各種雑草の茎葉部の全面に散布した。

薬液散布2週間後、各種雑草に対する除草効果を試験例1の判定基準に従い調査した。

結果は第4表に示す。

第4表

化合物 名	有効成分の 処理量(%)	種	ノ ビ エ	メ ヒ シ バ	コ ア カ ザ	ス ペ リ ヒ ユ	ハ ヤ ダ メ ギ タ	イ ス ガ ラ シ
1	50	5	5	5	0	0	0	0
	25	5	5	5	0	0	0	0
2	50	5	5	5	0	0	0	0
	25	5	5	5	0	0	0	0
3	50	5	5	5	0	0	0	0
	25	5	5	5	0	0	0	0
4	50	5	5	5	0	0	0	0
	25	5	5	5	0	0	0	0
5	50	5	5	5	0	0	0	0
	25	5	5	5	0	0	0	0
6	50	5	5	5	0	0	0	0
	25	5	5	5	0	0	0	0
7	50	5	5	5	0	0	0	0
	25	5	5	5	0	0	0	0
8	50	5	5	5	0	0	0	0
	25	5	5	5	0	0	0	0

## 試験例3 農作物に対する葉害試験(薬葉処理)

縦15cm、横22cm、深さ6cmのプラスチック製箱に収容した供試土壌を入れ、稲、大豆、ピート、ナタネ、ダイコン、カンラン、ナスの種子をそれぞれスポット状に播種し、約1.5cm覆土した。各種作物が初生葉展開期に達したとき、有効成分量が所定の割合となるように茎葉部に均一に散布した。

散布の際の薬液は前記配合例の水和剤または乳剤を水で希釈し、小型スプレーで各種作物の茎葉部の全面に散布した。

薬液散布2週間後、各種作物に対する葉害を下記判定基準に従い調査した。

結果は第5表に示す。

## 判定基準

- 5...作物はほとんど完全枯死
- 4... に対する葉害が顯著
- 3... 、葉害が認められる
- 2... 、葉害が若干認められる
- 1... 、葉害はほとんど認められない
- 0... 、葉害は認められず

第 6 表

化合物 No.	有効成分の 処理量(%a)	佛	大	ダ	カ	ナ	ビ
			豆	イ	ン	ラ	ス
1	50	0	0	0	0	0	0
	25	0	0	0	0	0	0
2	50	0	0	0	0	0	0
	25	0	0	0	0	0	0
3	50	0	0	0	0	0	0
	25	0	0	0	0	0	0
4	50	0	0	0	0	0	0
	25	0	0	0	0	0	0
5	50	0	0	0	0	0	0
	25	0	0	0	0	0	0
6	50	0	0	0	0	0	0
	25	0	0	0	0	0	0
7	50	0	0	0	0	0	0
	25	0	0	0	0	0	0
8	50	0	0	0	0	0	0
	25	0	0	0	0	0	0